

**PCT** WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales Büro  
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

<p><b>(51) Internationale Patentklassifikation <sup>5</sup> :</b> <b>A61K 31/565, A61L 15/03</b></p>	<b>AI</b>	<p><b>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:</b> <b>WO 90/04397</b></p> <p><b>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum:</b> <b>3. Mai 1990 (03.05.90)</b></p>
<div style="display: flex; justify-content: space-between;"> <div style="width: 48%;"> <p><b>(21) Internationales Aktenzeichen:</b> PCT/EP89/01200</p> <p><b>(22) Internationales Anmeldedatum:</b> 11. Oktober 1989 (11.10.89)</p> <p><b>(30) Prioritätsdaten:</b>  P 38 36 862.5      27. Oktober 1988 (27.10.88)    DE  P 39 10 578.4      29. März 1989 (29.03.89)      DE</p> <p><b>(71) Anmelder:</b> SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT  BERLIN UND BERGKAMEN [DE/DE]; Müllerstr.  170-178, D-1000 Berlin 65 (DE).</p> <p><b>(72) Erfinder:</b> GÜNTHER, Clemens ; Birkenstr. 5, D-1000 Berlin 21 (DE). TÄUBER, Ulrich ; Senheimer Str. 25D, D-1000 Berlin 28 (DE). SCHMIDT-GOLLWITZER, Karin ; Am Sandwerder 36, D-1000 Berlin 39 (DE). RIEDL, Jutta ; Friedbergstr. 21, D-1000 Berlin 12 (DE). TACK, Johannes-Wilhelm ; Tharsanderweg 42, D-1000 Berlin 20 (DE).</p> </div> <div style="width: 48%; vertical-align: top;"> <p><b>(81) Bestimmungsstaaten:</b> AT (europäisches Patent), BE (europäisches Patent), BG, CH (europäisches Patent), DE (europäisches Patent), DK, FI, FR (europäisches Patent), GB (europäisches Patent), HU, IT (europäisches Patent), JP, LU (europäisches Patent), NL (europäisches Patent), NO, RO, SE (europäisches Patent), SU.</p> <p><b>Veröffentlicht</b>  <i>Mit internationalem Recherchenbericht.  Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i></p> </div> </div>		

**(54) Title:** PREPARATION FOR TRANSDERMAL APPLICATION CONTAINING GESTODENE

**(54) Bezeichnung:** MITTEL ZUR TRANSDERMALEN APPLIKATION ENTHALTEND GESTODEN

**(57) Abstract**

A preparation for transdermal application contains gestodene possibly in combination with one or two oestrogens.

**(57) Zusammenfassung**

Ein Mittel zur transdermalen Applikation wird beschrieben, welches dadurch gekennzeichnet ist, daß es Gestoden gegebenenfalls in Kombination mit einem oder zwei Östrogen(en) enthält.

(19) World Intellectual Property Organization  
International Bureau



(43) International Publication Date  
14 February 2002 (14.02.2002)

PCT

(10) International Publication Number  
**WO 02/11768 A1**

(51) International Patent Classification<sup>7</sup>: **A61K 47/10**,  
47/12

(21) International Application Number: **PCT/EP01/09007**

(22) International Filing Date: **3 August 2001 (03.08.2001)**

(25) Filing Language: **English**

(26) Publication Language: **English**

(30) Priority Data:  
**PCT/EP00/07533 3 August 2000 (03.08.2000) EP**

(71) Applicant (for all designated States except US):  
**ANTARES PHARMA IPL AG [CH/CH];** Treuhand  
von Flue AG, Baarerstrasse 95, CH-6301 Zug (CH).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): **CARRARA, Dario**  
[AR/CH]; Antares Pharma AG, Gewerbestrasse 18,

CH-4123 Allschwil (CH). **PORTO, Gabriel [AR/CH];**  
Antares Pharma AG, Gewerbestrasse 18, CH-4123  
Allschwil (CH). **RODRIGUEZ, Jorge [AR/CH];** Antares  
Pharma AG, Gewerbestrasse 18, CH-4123 Allschwil (CH).

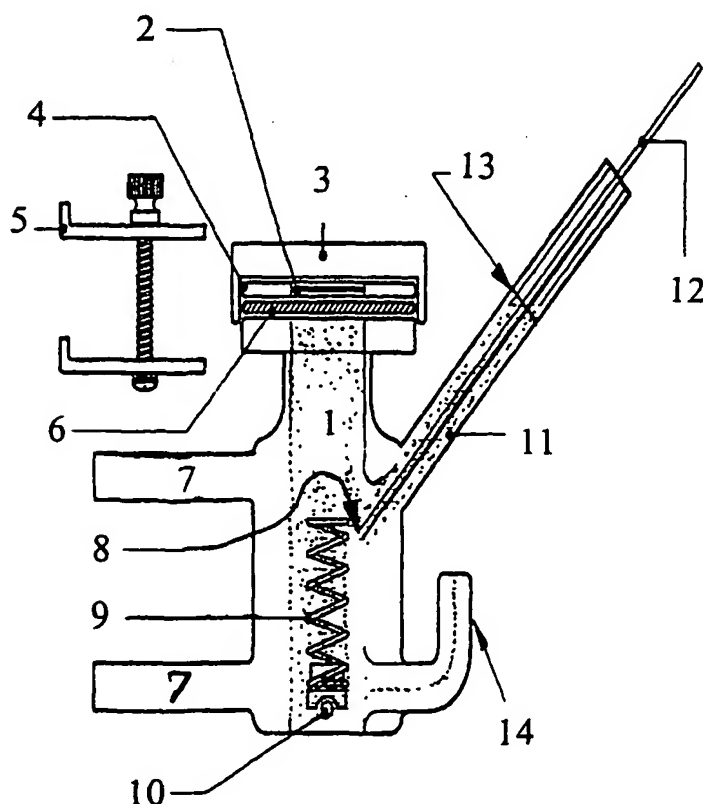
(74) Agent: **GERVASI, Gemma;** Notarbartolo & Gervasi  
S.p.A., Corso di Porta Vittoria, 9, I-20122 Milano (IT).

(81) Designated States (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,  
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,  
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,  
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,  
MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK,  
SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA,  
ZW.

(84) Designated States (regional): ARIPO patent (GH, GM,  
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian  
patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European  
patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE,  
IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF,

[Continued on next page]

(54) Title: **NOVEL COMPOSITION FOR TRANSDERMAL AND/OR TRANSMUCOSAL ADMINISTRATION OF ACTIVE COMPOUNDS THAT ENSURES ADEQUATE THERAPEUTIC LEVELS**



(57) Abstract: The present invention refers to a pharmaceutical composition suitable for the transdermal or transmucosal administration of one or more active agents, in form of a gel or a solution, comprising as a permeation enhancers a combination of: a) saturated fatty alcohol of formula  $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_n-\text{CH}_2\text{OH}$  or saturated fatty acid  $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_n-\text{CH}_2\text{COOH}$  wherein  $n$  is an integer number  $8 \div 22$ , preferably  $8 \div 12$ , most preferably 10, or unsaturated fatty alcohol or fatty acid of formula:  $\text{CH}_3(\text{C}_n\text{H}_{2(n-1)})-\text{OH}$  or  $\text{CH}_3(\text{C}_n\text{H}_{2(n-1)})-\text{COOH}$  wherein  $n$  is an integer number  $8 \div 22$ , b) a ternary vehicle or carrier consisting of a  $\text{C}_1 \div \text{C}_4$  alkanol, a polyalcohol in particular propylenglycol and water, c) optionally also a monoalkylether of diethyleneglycol.

WO 02/11768 A1